Requested Patent: JP55162772A

Title: PREPARATION OF SUBSTITUTED ACETIC ACID DERIVATIVE :

Abstracted Patent: JP55162772;
Publication Date: 1980-12-18;

Inventor(s): HAMADA YOSHINORI; others: 01;

Applicant(s): SHIONOGI\_CO LTD ;

Application Number: JP19800069434 19800523;

Priority Number(s):

IPC Classification:

C07D213/64; C07D213/65; C07D213/68; C07D213/70; C07D213/82; C07D213/85;

C07D215/22, C07D217/14, C07D217/24, C07D235/26, C07D239/32;

Equivalents:

ABSTRACT:

NEW MATERIAL A substituted acetic acid derivative of formula I (formula II is pyridine, pyrimidine, midazole or tetrazole; R is hydrocarbon group; A is O or S; formula II and the benzene ring may have a 1-SC substituent, condensed benzene ring or alicyclic ring which will not affect the reaction, -COR may be on the condensed benzene ring). EXAMPLE-2-(2-Phenoxy-5-pyridyl)-propionic acid. USE:A medicine or drug for an animal having improved anti-inflammatory action (including an antirheumatic action) and an analgesic action. PROCESS:A compound of formula III is reacted with an alicoxymethylene-thylydrocarbon group-substituted phosphorane to give a compound of formula IV, which is hydrolyzed and oxidized to form the compound of formula III. The compound of formula III can be obtained by reacting a halogenopyridine with a phenol or thiophenol in the presence of a basic substance if necessary.

## (19) 日本国特許庁 (JP)

①特許出願公開

## ⑫公開特許公報(A)

昭55-162772

⑤Int. Cl.³	識別記号	庁内整理番号	63公開	昭和	四55年(19	80)12	月:	18⊟
C 07 D 213/64		7138-4C						
213/65		7138-4C	発明 4	ク数	1			
213/68		7138-4C	審査部	青求	未請求			
213/70		7138-4C						
213/82		7138-4 C						
213/85		7138-4C						
215/22		73064 C						
217/14		7306-4C						
217/24		7306-4 C						
235/26		7306-4 C						
239/32		6670-4 C	*			(全	6	頁)

③置換酢酸誘導体の製造法

尼崎市武庫豊町2の5の53の30 3

②特 願昭55-69434

22 H

顧 昭49(1974)5月22日 大阪市

◎特 願 昭49─58244の分割

72発 明 者 浜田芳徳

⑪出 願 人 塩野義製薬株式会社

大阪市東区道修町 3 丁目12番地 74代 理 人 弁理士 岩崎光隆

最終頁に続く

32

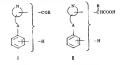
細書

/ 発明の名称

假機酢雑誘導体の製造法

2特許請求の範囲

一般式』で要わされる化合物にアルコキシメチレン三炭化水素筋整換フオスフオフンを反応させて得られる化合物を加水分解しついで解化して一般式』で表わされる化合物を得ることを特徴とする場合性機構進化の影浴法。



(武中、<sup>N</sup>)はピリジン、ピリミジン、イミダブー ルまたはテトラブールを表わし、Bは険化水業基 を表わし、Aは糖素または確置を表わし、<sup>N</sup>がよ び上記ペンゼン頭上には反応に影響を及ぼさない

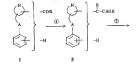
- / -

É

3個の置換基を有していてもよくあるいは総合べ 2円網入 ンゼン環または総合附環を有していてもよく-COB 基はこの総合ペンゼン環上にあつてもよい。

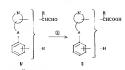
2 発頭の詳細な説明

本発明は複数的態態等外の製造性に関し、その 目的は優れた放気性作用(抗りつマチ作用も余む )および鎮無作用を示し匹架またに動物業として 有用な監験新物影響体を得る点にある。 本発明方法の製修に次式によって示される。



(以下余白)

- 2 -



14

(式中、心はピリコン、ピリミシン、スミダゾールまたはテトフソールを数わし、及は原化水素基 を数わし、人は糖菓または確請を表わし、心およ び上記ペンギン剤は反応に影響を及ばるないパー 3個の電機基を有していてもよくみるいは総合ペ ンギン園または総合能類を有していてもよく、 - COR 煮はこの総合ペンセン園上にあつてもよい。 ははアルルル版を形成し、

本発明方法は一般式1で扱わされる化合物をアルコキレメチレン三敗化水素實験フォスフオランと反応させるいわゆるウイティファヒ (Willis) 反応に付し (反応の)、得られる化合物目を加水分解に付し化合物以とした(反応の)後継化反応に

- 3 -



特欄略55-162772(2) 付して目的とする 置換酢酸誘導体 I を得る(反応 ③)ものである。

次に木発明方法の事態について詳細に記する。 反応①は通常のウイテイツヒ反応に従つて行えば よく、種々のアルコキシメチレン三炭化水素置換 フオスフオラン(例えば、メトキシメチレントリ フェニルフオスフオラン、メトキシメチレントリ (メトキシメチル) フオスフオラン。エトキシメ チレントリプチルフオスフォランなど)が原料化 合物と反応条件に応じて適宜選択し使用される。 例えば、上記コオスコオランにハロゲン化水素が 付加したフオスフオニウム塩を使用し、有機金属 (例えば、フエニルリチウム、プチルリチウムな ど)を用いてエーテル類(例えば、エーテル、ジ ビニルエーテル・テトラヒドロフランなど)中で 必要に応じて加温下で化合物しと反応させるか。 あるいはアルカリ金属アルコキサイド(例えば、 ナトリウムメチラート、ナトリウムエチョートな ど)を用いアルコキサイドと対応するアルコール 中で反応させるのが通常実際的である。反応は通



常不消性気息中で行われる。得られる化合物 II は ついで反応令すなわる加水分解反応に付し、アル コキンメチレン基をアルデモド系にする。この加 水分解は通常エノールエーラルを加水分解する際 に用いられる手段を用いることができる。例えば、 離として顕微、緩微、耐機工たはこれらと有機鍵 (例えば、新線)などとの混合物を用いることが でき、近高として水機化アルカリ、炭酸アルカリ などが用いられ水あるいは含水溶解の存在下で加 外することにより実施される。生成する化合物 以出版者するととにより実施される。生成する化合物 以出版者するととにより実施される。生成する化合物が

反応のほれ合物がのアルタドド基をカルボャンル派に変えるもので一般のアルタドド基をカルボ キンル高に変換する酸化反反に乗じて行えばよい、 例えば過ランガン極カリッム、適極化炭素、酸化 酸などにより水出または有機高端中で悪化しても よいし、引動、ラットを無・病感性と過酸位的、よ たは過酸化酢酸などにより増化してもよい。なお 上形反反の、のかよが個の工程において反応を要 けるほとの変化を関係を発生の変化を は、ないなになった。

- -



することにより、最終において目的化合物を得る ようにすることができる。

なお、原料化合物 I はハロゲノビリジン類にフェノール類またはチオフェノール類を必要に応じて 塩基性物質の存在下に反応させることにより、 製油される。

かくして得られた化合物目はもらに分離、構製 あるいは顕現化、その他の必要に応じて、適当な アルカリ金属塩(例えば、ナトリウム、カリウム など)、アルカリ土類金属塩(例えば、カルシウ ム、マグキシウム、バリウムなど)、その他アル にこっく単などに宿法に従って変熱することがで ある。

本発明方法の目的化合物である置換酢糖誘導体 及びその塩類は優れた抗炎症作用(抗リウマチ作 用も含む)または鎮痛作用を示し、医薬または動 物薬として有用な化合物である。

以下実施例において本発明方法の実施態様を示す。

実施例/



粉末にしたメトキシンチレントリフエムキフス スペカリのムのロフイド23248条エーテル スペカはに発機し、内限/5~20℃で / 123 ヒルフエニルリテクムエーラル電産6の料金摘下 後/3℃で / 5分割からませる。2~フェンキン ーメーアセナルビリシンス/4多のエーテル電標 / 4の4を32の分で域下接接電で、4時間からませる。不解機を印まし評解に水水を注ぎエーテル で他出する。抽出海を水底、影響情報を管主し 変症/2642 をいっガゲルカナショントに付 で成って425 といっガゲルカナショントを 好任 7歳42 といっガゲルカナショントに付 がにパンダン/前標エチル(50:/)溶出器を 経圧製性するとから45mtly 4Vア/44プCのユーフエ ノキレー3-(/-ノナルー2-ノトキンビニル )とリンシェメ1を得る。

元素分析 C<sub>2</sub>3B<sub>2</sub>0<sub>2</sub>N として 計算値: C<sub>2</sub>7K66:H. 6.27;N. 5.89 契数値: C<sub>2</sub>7K94:H. 6.37;N. 5.79 IR \* CCC 6.45; C.45£\*, C.590 NoRR 5.45 (CCC 6.2) 人ぞと、5.95 (2H. 4.3), 2.67. 3.70 (3H. 4.), 6.72. 6.33 (3H. 4.3)



Man - ナルボ、Man - ノトセン高、Ri ーエチル高。
Pr - ゴテロとル差、i ーPr - イリプロビル基。
Ba - ブチル族、i ーBa - イリプロビル
、- Bu - ェープテル茶、i ーBu - i ー ブテル蒸、
Ac - ママナル高、Aa - アンミリー高。
Ca (SH<sub>4</sub>O) - カルレウム Mu(An An Man)、
Ai - フルミュウム Au(An An An)。

- 9 -

(以下余白)



お間底55-162772(3) 本品人469を2N場様まのがに加え、選業気 漱中一般かきませた後皮皮原化ンセンリの46 人科製業気能中温マンガン種コリウム人39の水 溶練 30 46を20分で減下さらに深屋で、0分面 かきませた後不務物を評去し評談を収費水気ナト 切ので加まールとしてエーチルで指出する。 が場際で消止とした後エーテルで行の出出す 40 70 8場際で消止とした後里ーテルで行う出出す 41 0両をベンゼン/石油エーチルで再始品する。 支煙をモータのでの2-1 2-フェノキレー5-でリンル)プロピオン盤210可を得る。本品は 他の755により調整された幅急を同定された。 他の755により調整された幅急を同定された。

実施例2-103

以下実施例くと関係にして下記の化合物を得る。 なお、下記表巾で用いられる語号は下記の意味を 起わし、A機において例えばよーのほどりリン酸 の2位がエーテル結合していることを扱わし、 $X_1$ ,  $X_2$ ,  $Y_1$ ,  $Y_2$ はよび $Y_3$ 関において例えば w-clti2 ルが母様かな何を智識していることをあわす。

-8-

												_		-	-	-	_				-	_					_	5		
3,0	6	135~1355	119~1204	P66~86	1025~108.54	84~83d	111-011	56~26	114~113	Ca (2H20)/35~/36	C. (2H, 0)80~8/4	A164~65	129~/30d	101~102d	1145~1155	66~86	Ca (3gH20)/40~/4/	Ca (44H20)/55	92~93	108~107	103~108d	A1236	154~156d	Ca (2H20)/55~/57	C* (H <sub>2</sub> 0)/50	/60~/64 (発度)	C* (#H30)/87~189	Cs(2H20)/325~/335	Ca (4H20)/45	C. (H,0)205
,	.	m	111	113	Ħ	×	×	111	Ħ	Ħ	Ħ	Œ	×	Ħ	D.	Ħ	×	×	Ħ	Ħ	Ħ	×	ж	×	TI,	Ħ	×	Ħ	н	=
	2	×	н	×	ж	ж	111	×	×	æ	Ħ	×	×	Ħ	Ħ	Ħ	Ħ	35	×	Ħ	Ħ	33	32	н	н	H	H	H	H	723
		35	13-1	115	3-C 8	3-61	#-C#	33	#-C #	н	10-11	10 m	1 0M-7	4-Me	×	474-77	Ħ	4-Met	#-C#	3-C	K-CN	# C #	₩-соон	3-CF,	#-C #	4-CONH2	HO-76	4-0Ae	# OV¢	H0-#
١,	7	122	Ħ	33	Ħ	Ħ	×	н	m	Ħ	Ħ	Ħ	н	111	Ħ	щ	щ	Ħ	×	Ħ	Ħ	×	32	×	Ħ	щ	111	Ħ	Ħ	=
	x, x,	125	×	×	щ	×	æ	×	Ħ	Ħ	Ħ	Ħ	Ħ	Ħ	33	33	ж	Ħ	111	m;	Ħ	Ħ	Ħ	32	T.	×	Ħ	н	H	22
1	+	0-5	2-0	2-0	2-0	7-0	7-0	2-0	0-9	9-0	9-9	2-S	7-0	2-0	S-9	0-9	2-8	9-9	2-0	9-0	2-0	9-0	2-0	2-0	S-9	2-0	7-0	2-0	9-0	0-9
	pd .	Me	Me	Me	Me	Me	Ň	ŵ	W	W	W,	W	Me	Me	å	Ň	¥	Me	ğ	Ř	Me	ផ	Me	Me.	Ϋ́	We	Me	We	W	Me
es-	-СИСООН О-СИСООН	~	я	я	*	3	<b>س</b>	m	m	7	7	*	*	*	~	'n	*	m	3	~	3	87	*	*	~	*	*	*	'n	m
大路田	¥	7	m	¥	4	9	4	*0	۰	01	:	73	/3	*/	5/		13	*/	6/	30	77	77	73	74	25	3.6	22	37	73	30

(32~/334 (42~/434 (36~1374 (19~/20 /130~/2/ /135~/36 (15~/6 (5~/6 65~67	32~/33 33~/33 33~23 10~20 10~20 10~10 13~13 15~11 15~11 15~11 15~11 15~11	2							
736 736 736 736 736 736 736 736 736 736		2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2		111111111111111111111111	さっていていることとなっていることは、これでは、こうこうこうこうこう	さっていていること こうしょうしょ こうしょう アーファンシング	までついて で こう 6 6 2 7 6 7 7 8 8 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7	2 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1	- 1,20 m
		m 0 - m m m m - 2 4 5 7 9	236- 206- 20- 20- 20- 20- 20- 20- 20- 20- 20- 20	1 - 6 - 6 - 6 - 6 - 6 - 6 - 6 - 6 - 6 -	336-13 336-13 336-13 336-13 337-13 337-13 337-13 337-13 337-11 337-11 337-11 337-11	38-13 38-13 38-13 38-13 38-13 38-13 38-13 18-11	336-13 36-12 36-12 36-12 36-13	33-13; 38	236-1334  236-1334  237-120  2
		207 1 1 1 1 1 2 2 2 2 2 3 2 3 3 2 3 3 3 3 3	H 1/9~ H 1/3~ H 1/3~ H 1/3~ H 1/5~ H 8/~ H 1/20~	206~199 179	4 ( ( ( 4 ( 4 ( 4 ( 4 ( 4 ( 4 ( 4 ( 4 (	4	4	4	4
					и и и и и и и и и и и и и и и и и и и	и и и и и и и и и и и и и и и и и и и	и и и и и и и и и и и и и и и и и и и	и и и и и и и и и и и и и и и и и и и	и и и и и и и и и и и и и и и и и и и
н н н н н н н н н н н н	н н н н н н н н н н н н н н н н н н н	н н н н н н н н н н н н н н н н н н н	н н н н н м м н н м м м н н м м м м м м	нин — — и и и и и и и и и и и и и и и и					
34-477/ H H H H H H 2-46 3-4 2-04 H 3-46 H	74	7	, , , , , , , , , , , , , , , , , , ,	T	7	(HO)	E CHIO	E CON.).	(CH <sub>2</sub> ), -
m	, m	m, " *	, v v	en si s		BB.	2 PB	E E E E E E E E E E E E E E E E E E E	(CH <sub>2</sub> ), -
m	, n	m	, n	, v v	H H H H H H C C C C C C C C C C C C C C	н н н н н н н н н н н н н н н н н н н	и и и и и и и и и и и и и и и и и и и	н н н н н н н н н н н н н н н н н н н	В В В В В В В В В В В В В В В В В В В
m	, n	, n	m	, v	2 - N - S - S - S - S - S - S - S - S - S	2 - H H H H H H H H H H H H H H H H H H	3 - R R R R R R R R R R R R R R R R R R	3 - H H H H H H H H H H H H H H H H H H	3 - ж н н н н н н н н н н н н н н н н н н
'n			m	, T T	3-Ke	3-14c, 10c, 10c, 10c, 10c, 10c, 10c, 10c, 10	3-Ke H H H H H E-F	3-Ke  H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	3-Ke H H H H H H H H H H H H H H H H H H H
				,3 80	H H H C C C C C C C C C C C C C C C C C	B H H H C C C C C C C C C C C C C C C C	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H
				a m	Вв. 4-4-4-4-4-4-4-4-4-4-4-4-4-4-4-4-4-4-4-	ва	н н н н н н н н н н н н н н н н н н н	H H H G G G G G G G G G G G G G G G G G	18 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1
				2	E	н н н н н н н н н н н н н н н н н н н	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	E E E E E E E E E E E E E E E E E E E	11
				,s	2-46 13-46 13-46 14-46 15-	5-Ke H H H B S W B B B B B B B B B B B B B B B B B B B	5-Ke H H H H H H C F Ke E F Ke	1	2-44c 1-4c
,s	н н н <sub>8</sub> %-£	н н 3-м-ғ	3-Ne H		H = 4K-2 H = 4K	1	7-25 H 4-2 H	-( FH )	2.45 H H S S S S S S S S S S S S S S S S S
, , , , , , , , , , , , , , , , , , ,	н н ж. ж. н н н	н н 3-% н	3-% н н н	H	H + 9K-9	H 44.45 H 6-Mc-0 H 6-Mc-0 H 7-Mc-0 H 7-	# # # # # # # # # # # # # # # # # # #	# 5 # 5 # 5 # 5 # 5 # 5 # 5 # 5 # 5 # 5	H 18-7 H 18-7
	н н н н н н н н н н н н н н н н н н н	н н н н н н н н н н н н н н н н н н н	3-% н н 5-%	н н 3-М• н	6-Mr H  9-Me H  9-Me H  9-Me 2-Me  4-Me 5-Me  4-Me 5-Me	6-Me H  4-Me H  5-Me 2  H  5-Me 2-Me  4-Me 5-Me  4-Me 5-Me  4-Me 5-Me  4-Me 6-Me	H - M- S H - S-Mc H - S-Mc	2 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 -	6-44 H
	н н н в н н н н н н н н н н н н н н н н	3-We H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	3-M-2 H H M-2 H + M-2	н н эм-э	μ-Me H  3-Me β-Me  μ-Me β-Me  μ-Me β-Me  μ-Me β-Me	### H	4-Me H 3-Me H 3-Me 2-Me 4-Me 5-Me 4-Me 5-Me 4-Me 6-Me 4-Me 3-Me 4-Me 3-Me 4-Me 3-Me	2-M° B  3-M° B  4-M° 3-M°	2-Me H 2 2-Me H 2 2-Me 2-Me 4-Me 2-M
- W - W - W - W - W - W - W - W - W - W	н н -6 м -9 м	н эм-е н н м-эм-э н эм-эм-э н эм-эм-э	н н м-2 н м-2 н м-4	H W A A	5-Me H 3-Me 5-Me 4-Me 5-Me 4-Me 5-Me	3-Me H 3-Me 5-Me 44-Me 5-Me 44-Me 5-Me 44-Me 5-Me 44-Me 7H, 1, H	5-Me H 3-Me 5-Me 4-Me 5-Me 4-Me 5-Me 4-Me 6-Me 7-Me 7-Me 7-Me 1-Me 3-Me 3-Me 3-Me	2-Me H 3-Me 2-Me 4-Me 2-Me 4-Me 2-Me 4-Me 2-Me 7-Me 7-Me 7-Me 7-Me 7-Me 7-Me 7-Me 7	2-Me H 3-Me 3-Me 4-Me 3-Me 4-Me 3-Me 4-Me 6-Me 1H <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - H 6-Me 4-Me 6-Me 4-Me 6-Me 1H <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> - H 6-Me 4-Me 6-Me 4-Me 6-Me 4-Me 6-Me 6-Me 1-Me 1-Me 1-Me 1-Me 1-Me 1-Me 1-Me 1
2-4c 5-7c 4c	н н -6 м -3 м -9 м -7	н н н н н н н н н н н н н н н н н н н	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	H W-79	3-Me 5-Me 4-Me 5-Me 4-Me 5-Me	3-Me 5-Me 4-Me 5-Me 4-Me 5-Me 4-Me 6-Me H	3-Me 5-Me 4-Me 5-Me 4-Me 5-Me 4-Me 6-Me 1H <sub>2</sub> ) <sub>a</sub> - H	3-Me 5-Me 1-Me 1-Me 1-Me 1-Me 1-Me 1-Me 1-Me 1	3-Me 5-Me 6-Me 15-Me 15-
B H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	3-Me H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	н н н н н н н н н н н н н н н н н н н	H + + + + + + + + + + + + + + + + + + +	н - X-2 н - X-4 н - X	4-Me 5-Me 4-Me 5-Me 4-Me 6-Me	4-Me 5-Me 4-Me 5-Me 4-Me 6-Me H H	μ-Me 5-Me μ-Me 5-Me μ-Me 6-Me 7H <sub>2</sub> ) μ− H 3-Me 5-Me	4-Me 5-Me 4 4-Me 5-Me 4 4-Me 6-Me 4 H <sub>2</sub> ) ,- H ( 3-Me 5-Me 4 4-Me 5-Me	μ-λε 5-Με , μ-λε , μ-λ
8 H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	H 9M-6 H 9M-7 H 9M-7 H 9M-7 H 9M-7 H 9M-7 H 9M-7	H + + + + + + + + + + + + + + + + + + +	4-Me 5-Me	#-Me 5-Me #-Me 6-Me 3H <sub>2</sub> ) #-	#-Me \$-Me #-Me \$-Me \$H_2)_u_ 3-Me \$-Me	#-Me 5-Me . #-Me 6-Me . H <sub>2</sub> ) _ = H (	μ-Me 5-Me . μ-Me 6-Me . H <sub>2</sub> ) μ H (
81 H H K-Ke  1	2-Me H  3-Me H  5-Me H  6-Me H  4-Me H  5-Me H  5-Me H  6-Me H  6-Me H  6-Me H  6-Me S-Me	н н н н н н н н н н н н н н н н н н н	H = 4K-E H = 4K-3 H = 5K-3 H = 5K-3 H = 5K-5 H = 5K-5 1K-5	3W-5 3W-6 H 3W-5 3W-6 H 3W-5 H 3W-5	4-Me 6-Me	H 6-Me	H <sub>2</sub> ) "- He 6-Me 3-Me 5-Me	H <sub>2</sub> ) <sub>a</sub> = H (H <sub>2</sub> ) <sub>a</sub> = H (H <sub>2</sub> ) <sub>a</sub> = H (H <sub>2</sub> ) <sub>a</sub> = He (H <sub>2</sub> ) <sub>a</sub> = He (H <sub>2</sub> ) <sub>a</sub> = He	#H <sub>2</sub> ) "- H (  3-Me 5-Me .  4-Me 5-Me .  CH <sub>2</sub> ) "- H
6. Me	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H		33 1 <sub>3</sub>	2H <sub>2</sub> ) <sub>u</sub> — H 3 — Me 5 — Me	3-Me 5-Me 5-Me 5-Me	H <sub>2</sub> ) <sub>u</sub> H ( 3-Me 5-Me . 4-Me 5-Me .

実施例	R CHCOOH の位置	R	-A-	x,	х,	Υ,	Y ,	Y,	wh (,C )
65	3	Me	6-0	H	н	23-~	ンブ	H	131~132
66	3	Мe	6-0	4-Me	5-Me	H	H	H	144~145
67	4	Мо	2-0	5,6-	ベンバ	H	H	н	Ca(/5HD)2/6~2/7
68	3	Ме	6-0	4.5-	ベンチ	H	H	н	122~123
69	3	Me	6-0	4.5-(0	H2)4-	H	H	Н	151~152
70	3	Me	6-0	H	н	34-(CH	,) <sub>j</sub> —	Н	1225~1235
71	3	Me	#6-0	Н	н	3-Me t	Н	Н	69.5~70.5
72	3	Ме	6-0	2-Me	4-Me	H	Н	н	C * ( /,5H <sub>2</sub> O)2/8d
. 73	3	Me	6-0	н	н	<b>4</b> −0H	Н	Н	167~169
74	3	Ме	6-0	н	H	4-Ac0	Н	H	161~162
75	3	Мe	6-0	н	H	4-i-Pr	Н	н	89~91
76	3	Me	6-0	н	H	4∕-P r	Н	Н	81.5~825
77	3	Ме	6-0	н	н	4-t-B u	Н	Н	112~113
78	3	Me	6-0	н	н	4-s-Bu	Н	H	67~71
79	3	Me	6-0	н	H	4-Bu	Н	Н	Ca(H_D)/40~/42
80	3	Ме	6-0	н	н	4-i−Bu	н	н	Ca //4~//9(d)

1

#	
энсоон	
5, 1	
2 -	
» \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	
1	
ĭ	
743	
*****	
/ " \ "	
× ×	

大路利	×′	×	フェノキン語の位職	*	≽"	ピュナの ひょな信かな がま	(0,)4
20	H	=	7	ш	Ħ	m	26~27
5	н	H	78	н	н	*	129~130
90	S-CN	Ħ	7	H	н	*	198-200
**	\$-CONH,	Ħ	7	Ħ	22	*	211~212
\$ 5	Ħ	H	m	н	Ħ	*	130-131
86	н	н	*	Ħ	Ħ	*	181-081
83	34-(CH2),	1, 1, L	7	Ħ	Ħ	*	166~167
60 60	34ーベンブ	5	7	::1	m	*	145~147
60	3-Me	4-Me	n	н	H	*	1555~156
06	4-Me	5-M°	71	H	Ħ	*	142~143
16	«-M-»	н	71	Ħ	#	*	123~124
9.2	eN-9	,==	7	н	Ħ	¥	Ca (H20)273-275
9	5-Br	H	7	Ħ	111	*	137~138
*6	2-Me	н	*	Ħ	Ħ	*	152-153
9.5	5-Me	Ħ	7	Ħ	Ħ	*	132~134
96	3-Me	Ħ	7	æ	Ħ	¥	121~122
6.6	н	Ħ	71	3-1/6	H	*	107~108
86	н	H	71	3-Me t	Ħ	*	C . (4H 20)/584
66	:	H	7	н	Ħ	*	136~138
100	m	Ħ	71	2 Me	Ħ	*	180~181
101	н	H	7	3-C#	Ħ	*	66~86
102	Ħ	H	7	2-C	::4	*	145~146
	:	-		3-6	\$-C &	7	137~138

実施例 / 0 4 - 1 0 7 実施例 / と同様にして下記の化合物を得る。 ユー〔6 - ( 2 - ビリジルオャン) - 2 - ナフチル〕プロビオン酸、や 1 9 7~ 1 9 8℃。

ユー(ザー(/ーフエニルー/ユネザーテトラ ゾリルオキシ)フエニル)プロピオン酸、卵/65 \*.\* ~/66°C。

~ / o o C。 2 - ( 4 - ( 2 - ピリミンルオキシ ) フェニル ) ブロピオン酸、聖 / フザ~ / フ5 C。

2-〔4-(/-メチルー2-ベンズイモダゾ イルオキシ )フエニル )プロピオン酸、卵/84 ~/85℃。

> 特許出顧人 塩野義製業株式会社 代 期 人 弁理士 岩崎 光彩

> > - / 4 -

第1頁の続き

6)Int. Cl.<sup>3</sup> 識別記号 庁内整理番号 #A 61 K 31/415 A B G 31/44 A B E 31/455 A A H

ABG

31/47 ⑫発 明 者 岡田哲夫

堺市三条通2の5